

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representation of  
The original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND****PRIORITY  
DOCUMENT**SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

EP99/7125

REC'D	03 NOV 1999
WIPO	PCT

09806567

**Bescheinigung**

Die BASF Aktiengesellschaft in Ludwigshafen/Deutschland hat eine Patentanmeldung unter der Bezeichnung

"Verwendung von substituierten 5-Hydroxypyrazole, Verfahren  
zu deren Herstellung, sowie sie enthaltende Mittell"

am 2. Oktober 1998 beim Deutschen Patent- und Markenamt eingereicht.

Das angeheftete Stück ist eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlage dieser Patentanmeldung.

Die Anmeldung hat im Deutschen Patent- und Markenamt vorläufig die Symbole C 07 D und A 01 N der Internationalen Patentklassifikation erhalten.

München, den 15. Juli 1999

**Deutsches Patent- und Markenamt**

**Der Präsident**

Im Auftrag

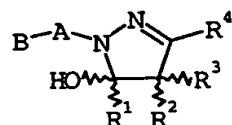
Aktenzeichen: 198 45 509.7

Sieck

## Patentansprüche

## 1. Verwendung von 5-Hydroxypyrazolinen der Formel I

5



I

10 in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

B ggf. subst. Aryl oder ggf. subst. Hetaryl;

A C=O, C=S oder SO<sub>2</sub>;

15

R<sup>1</sup> C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Halogen-  
alkinyl,

20

ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkyl, ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloal-  
kenyl, ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkinyl, oderggf. subst. Aryl, ggf. subst. Heterocyclyl oder ggf.  
subst. Hetaryl;

25

R<sup>2</sup> Wasserstoff;R<sup>3</sup> Wasserstoff, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenal-  
kyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl,

30

C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenal-  
kinyl, wobeiR' unabhängig voneinander Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl  
bedeutet;

35

oder R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gemeinsam eine Gruppe=O, =S oder =N-O-R<sup>5</sup>, wobeiR<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alki-  
nyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl bedeutet;

40

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, COOR' oder Heterocyclyl;

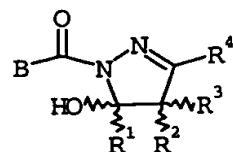
zur Bekämpfung von Schadpilzen.

45

702/98 Ni/cz 02.10.1998

2

2. 5-Hydroxypyrazoline der Formel IA gemäß Anspruch 1,



IA

5

in der im Fall a:

R<sup>3</sup> Nitro, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
10 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenal-  
kinyl;

oder R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gemeinsam eine Gruppe

15

=O, =S oder =N-O-R<sup>5</sup>, bedeutet,

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder Heterocyclyl;

20

und B, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben,  
oder

im Fall b:

25

B ggf. subst. Naphthyl, ggf. subst. Heterocyclyl, ggf.  
subst. Hetaryl oder substituiertes Phenyl, undR<sup>3</sup> Wasserstoff,

30

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder Heterocyclyl bedeutet;

35

wobei R<sup>4</sup> nicht für Methyl steht, wenn R<sup>1</sup> Methyl, tert. Butyl  
oder Phenyl und die Gruppe B Phenyl bedeutet, welches durch  
3-Brom, 4-Halogen, 4-Methyl, 4-Methoxy, 4-Nitro, 4-Dimethyl-  
amino oder 4-Fluor-3-Methyl substituiert ist, und

40

wobei R<sup>4</sup> nicht für Ethyl steht, wenn sowohl die Gruppe B und  
R<sup>1</sup> 4-Fluorphenyl bedeutet, oder

im Fall c:

B unsubstituiertes Phenyl,

45

3

R<sup>1</sup> ggf. subst. Aryl, ggf. subst. Heterocyclyl oder ggf.  
subst. Hetaryl,

5 ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkyl, ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloal-  
kenyl, ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkinyl,

ggf. subst. n-Propyl, ggf. subst. C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, CHCl<sub>2</sub>,  
CH<sub>2</sub>Cl, CCl<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>2</sub>H, CF<sub>2</sub>Cl, CFCl<sub>2</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkyl,  
ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkenyl, ggf.

10 subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkinyl;

R<sup>2</sup> Wasserstoff;

15 R<sup>3</sup> Wasserstoff, Nitro, Cyano, Amino, Methylamino, Dimethyl-  
amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkinyl,

oder R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gemeinsam eine Gruppe

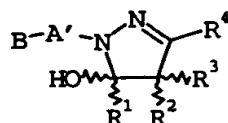
20 =O, =S oder =N-O-R<sup>5</sup>, und

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder Heterocyclyl bedeuten;

25 wobei R<sup>1</sup> nicht für tert. Butyl steht, wenn R<sup>4</sup> CF<sub>2</sub>H bedeutet  
und R<sup>4</sup> nicht für Methyl steht, wenn R<sup>1</sup> Phenyl bedeutet.

3. 5-Hydroxypyrazoline der Formel IB gemäß Anspruch 1.

30

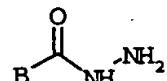


IB

35 in der

A' C=S oder SO<sub>2</sub> bedeuten.

4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel IA ge-  
40 mäß Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Hydrazin  
der Formel II,



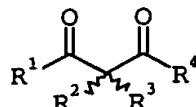
II

45

in der B die in Anspruch 2 gegebene Bedeutung hat,

4

mit einem Diketon der Formel III,

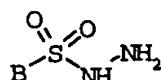


III

5

in der die Substituenten die in Anspruch 2 gegebenen Bedeutungen haben, umsetzt.

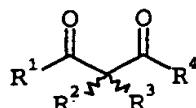
5. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel IB gemäß Anspruch 3, in der A' C=S bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 mit Lawesson-Reagenz umsetzt.
10. 6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel IB gemäß Anspruch 3, in der A' SO<sub>2</sub> bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man Sulfonylhydrazine der Formel IV,



IV

20

in der B die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung hat, mit Diketonen der Formel III,



III

25

in der die Substituenten die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, umsetzt.

30. 7. Verwendung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 als Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel IB gemäß Anspruch 3, in der A' C=S bedeutet.
35. 8. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
9. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schadpilzen geeigneten Mittels.
40. 10. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

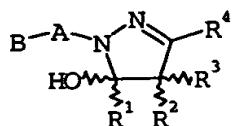
Verwendung von substituierten 5-Hydroxypyrazolen, neue 5-Hydroxypyrazole, Verfahren zu deren Herstellung, sowie sie enthaltende Mittel

5

### Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von 5-Hydroxypyrazolinen der Formel I

10



I

15 in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

B ggf. subst. Aryl oder ggf. subst. Hetaryl;

A C=O, C=S oder SO<sub>2</sub>;

20

R<sup>1</sup> C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkinyl,

ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkyl, ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalke-

25

nyl, ggf. subst. C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkinyl, oder

ggf. subst. Aryl, ggf. subst. Heterocyclyl oder ggf. subst. Hetaryl;

30 R<sup>2</sup>

Wasserstoff;

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkinyl, wobei

35

R' unabhängig voneinander Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet;

oder R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gemeinsam eine Gruppe

40

=O, =S oder =N-O-R<sup>5</sup>, wobei

R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl bedeutet;

45

2

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, COOR' oder Heterocyclyl;

zur Bekämpfung von Schadpilzen, sowie sie enthaltende Mittel.

5

Außerdem betrifft die Erfindung neue 5-Hydroxypyrazole und Verfahren zu deren Herstellung.

Substituierte Pyrazolin-5-one mit herbizider und fungizider Aktivität sind aus DE-A 37 28 278 bekannt, fungizid wirksame 3-Arylpyrazole sind in WO-A 94/29276 offenbart.

Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter 15 Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurde die Verwendung von substituierten 5-Hydroxypyrazolen der Formel I als Fungizid, sowie sie enthaltende Mittel gefunden.

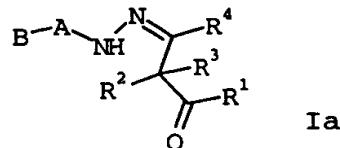
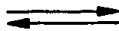
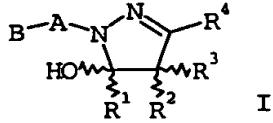
20

Einzelne 1-Benzoyl-5-hydroxy-pyrazoline sind aus Acta Chem. Scand., Bd. 24, S. 1744 (1970); Zh. Org. Khim., Bd. 15, S. 1100 (1979); ebd., Bd. 16, S. 415 und S. 2235 (1980); ebd., Bd. 17, S. 284 (1981); ebd., Bd. 18, S. 762 (1982); ebd., Bd. 20, S. 1371 (1984); ebd., Bd. 21, S. 2493 (1985); ebd., Bd. 22, S. 286 und S. 2043 (1986); ebd., Bd. 23, S. 1433 (1987); Khim. Geterotski Soedin., Bd. 9, S. 1210 (1987); Indian J. Chem. Sect.B, Bd. 29B, S. 887 (1990); Inorg. Chem., Bd. 31, S. 598 (1992); J. Fluorine Chem. Bd. 65, S. 21 (1993) und Tetrahedron. Bd. 50, S. 11447 (1994) bekannt. Die biologische Aktivität dieser Verbindungen ist 30 im Stand der Technik jedoch unbekannt.

Verbindungen der Formel I liegen in einem tautomeren Gleichgewicht mit der offenkettigen Form Ia vor [vgl.: J. Org. Chem. 35 USSR, S. 2037 (1983); ebd. S. 1247 (1984)].

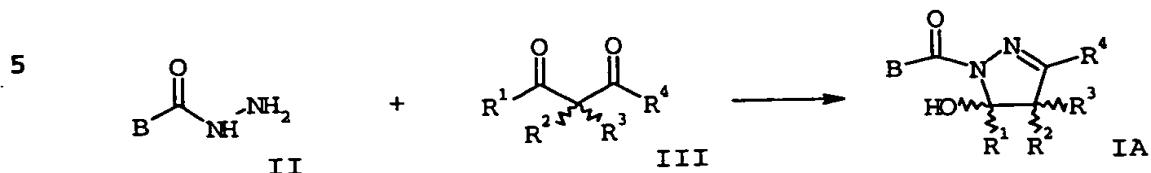
Die Erfindung bezieht sich damit auf beide Formen, auch wenn aus Gründen der Übersichtlichkeit stets nur die Ringform I genannt wird.

40



45

Verbindungen der Formel I, in denen A für C=O steht (Formel IA), können beispielsweise auf dem folgenden Weg erhalten werden:



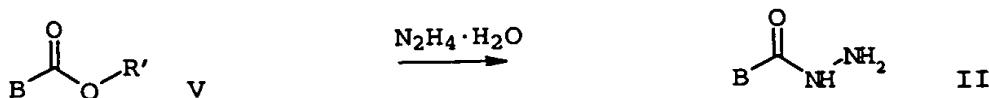
10 Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise 20°C bis 100°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel [J. Org. Chem. USSR (Engl. Transl.), Bd. 16, S. 371 (1980); ebd. Bd. 21, S. 2279 (1985); ebd., Bd. 22, S. 250 (1986); ebd., Bd. 23, S. 1291 (1987); Indian J. Chem. Sect. B, Bd. 29, S. 15 887 (1990); Bull. Soc. Chem. Jp., Bd. 62, S. 3409 (1989)].

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylool, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform 20 und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt 25 Methanol, Ethanol und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, III in 30 einem Überschuß bezogen auf II einzusetzen.

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Hydrazide der Formel II sind in der Literatur bekannt [vgl. J. Heterocycl. Chem. Bd. 16, S. 561 (1976); Helv. Chim. Acta, Bd. 27, S. 883 35 (1944); J. Chem. Soc. (1943) S. 413] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Hydrazide der Formel II werden üblicherweise aus den entsprechenden Carbonsäureestern der Formel V durch Umsetzung mit Hydrazinhydrat hergestellt. In Formel V steht R' für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.

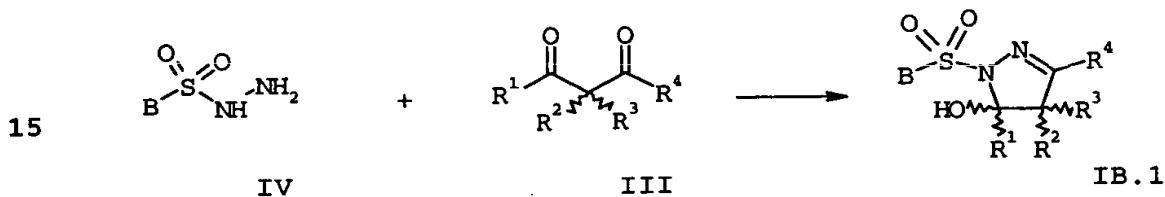


45 Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise 20°C bis 100°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. J. Heterocycl. Chem. Bd. 16, S. 561 (1976);

Helv. Chim. Acta, Bd. 27, S. 883 (1944); J. Chem. Soc. (1943) S. 413].

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Diketone 5 der Formel III sind ebenfalls in der Literatur bekannt [Organikum, VEB Verlag der Wissenschaften, 15. Aufl. S. 584ff., Berlin 1976] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

10 Verbindungen der Formel I, in denen A SO<sub>2</sub> bedeutet (Formel IB.1), sind bevorzugt auf dem folgenden Weg zugänglich:



Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den für die Herstellung der Verbindungen IA angegebenen Bedingungen.

20

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, III in einem Überschuß bezogen auf IV einzusetzen.

25 Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Sulfonylhyclazide der Formel IV sind in der Literatur bekannt [J. Chem. Soc. Chem. Commun. (1972) S. 1132; J. Chem. Soc. (1949) S. 1148; Helv. Chim. Acta, Bd. 42, S. 996 (1962)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

30

Die Verbindungen der Formel I, in denen A für C=S steht (Formel IB.2), sind aus den entsprechenden Verbindungen der Formel IA durch Umsetzung mit einem Schwefelungssalz zugänglich.



40 Die Schwefelung von IA erfolgt unter an sich bekannten Bedingungen, sie erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 180°C, vorzugsweise 20°C bis 140°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. Liebigs Ann. Chem., S. 177 (1989)].

45 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylool, halogenierte Kohlenwas-

serstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Di-oxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, sowie Dimethylsulfoxid, besonders bevorzugt Toluol 5 und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Schwefelungsagentien kommen beispielsweise Phosphorpentasulfid oder Lawesson-Reagenz in Betracht.

10

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräun- 15 licher, zäher Öle an, die unter verminderter Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gerei- nigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

20

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

25 Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasser-  
stoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B.  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Me-  
30 thyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methyl-  
butyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl,  
1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl,  
1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl,  
1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl,  
35 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethyl-  
butyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethyl-  
propyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis  
40 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen  
Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch  
Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B.  
C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl,  
Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl,  
45 Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl,  
1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Di-  
fluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-

2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl  
und Pentafluorethyl;

**Alkoxy:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis  
5 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein  
Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

**Halogenalkoxy:** geradkettige oder verzweigte Halogenalkylgruppen  
mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche  
10 über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

**Alkylthio:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10  
oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche  
über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

15 **Alkylamino:** eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 10  
bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über  
eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden ist;

20 **Dialkylamino:** zwei voneinander unabhängige geradkettige oder ver-  
zweigte Alkylgruppen mit jeweils 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie  
vorstehend genannt), welche über ein Stickstoffatom an das Gerüst  
gebunden sind;

25 **Alkylcarbonyl:** eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit  
1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über  
eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

30 **Alkoxy carbonyl:** eine Alkoxygruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen  
(wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-)  
an das Gerüst gebunden ist;

35 **Alkylthiocarbonyl:** eine Alkylthiogruppe mit 1 bis 10 Kohlenstoff-  
atomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe  
(-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

40 **Alkylsulfonyl:** eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit  
1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über  
eine Sulfonylgruppe (-SO<sub>2</sub>-) an das Gerüst gebunden ist;

45 **Dialkylaminosulfonyl:** eine Dialkyaminogruppe (wie vorstehend ge-  
nannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO<sub>2</sub>-) an das Gerüst ge-  
bunden ist;

**Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasser-  
stoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer  
Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie

Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl,  
2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl,  
1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl,  
3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl,  
5 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl,  
3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Me-  
thyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl,  
1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-  
propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl.

- 10 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl,  
4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl,  
3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl,  
2-Methyl-3pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl,  
1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl,  
15 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-but enyl, 1,1-Dimethyl-3-bute-  
n yl, 1,2-Dimethyl-1-but enyl, 1,2-Dimethyl-2-but enyl, 1,2-Dime-  
thyl-3-but enyl, 1,3-Dimethyl-1-but enyl, 1,3-Dimethyl-2-but enyl,  
1,3-Dimethyl-3-but enyl, 2,2-Dimethyl-3-but enyl, 2,3-Dimethyl-1-  
but enyl, 2,3-Dimethyl-2-but enyl, 2,3-Dimethyl-3-but enyl, 3,3-Di-  
20 methyl-1-but enyl, 3,3-Dimethyl-2-but enyl, 1-Ethyl-1-but enyl,  
1-Ethyl-2-but enyl, 1-Ethyl-3-but enyl, 2-Ethyl-1-but enyl, 2-Eth-  
yl-2-but enyl, 2-Ethyl-3-but enyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl,  
1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und  
1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

25 **Halogenalkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Koh-  
lenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dop-  
pelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt),  
wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder voll-  
30 ständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere  
Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkenyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwas-  
serstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbin-  
35 dung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbarten, Po-  
sition (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom  
(-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkenylcarbonyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Koh-  
40 lenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dop-  
pelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt),  
welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden  
sind;

45 Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen  
mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifach-  
bindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie

Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl,  
1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl,  
4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-  
butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-  
propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl,  
1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl,  
2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl,  
3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl,  
1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-  
butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-  
2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-  
1-methyl-2-propinyl;

15 Halogenalkinyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

20 Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6, 8, 10 oder 12 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

25 Cycloalkoxy: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

30 Cycloalkylamino: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 12 Kohlenstoffringgliedern (wie vorstehend genannt), welche über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden sind;

35 Heterocyclyl: 5- oder 6-gliedrige Heterocyclen enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuran, 3-Tetrahydrofuran, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl,  
40 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Iothiazolidinyl, 4-Iothiazolidinyl, 5-Iothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl,  
45 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl,

1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl,  
2,4-Dihydrofuran-2-yl, 2,4-Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl,  
2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydro-  
thien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl,  
5 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazo-  
lin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazo-  
lin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, 4-Isoxazo-  
lin-5-yl, 2-Iothiazolin-3-yl, 3-Iothiazolin-3-yl, 4-Iothiazo-  
lin-3-yl, 2-Iothiazolin-4-yl, 3-Iothiazolin-4-yl, 4-Iothiazo-  
lin-4-yl, 2-Iothiazolin-5-yl, 3-Iothiazolin-5-yl, 4-Iothiazo-  
lin-5-yl, 2,3-Dihdropyrazol-1-yl, 2,3-Dihdropyrazol-2-yl,  
2,3-Dihdropyrazol-3-yl, 2,3-Dihdropyrazol-4-yl, 2,3-Dihdropy-  
razol-5-yl, 3,4-Dihdropyrazol-1-yl, 3,4-Dihdropyrazol-3-yl,  
3,4-Dihdropyrazol-4-yl, 3,4-Dihdropyrazol-5-yl, 4,5-Dihdropy-  
razol-1-yl, 4,5-Dihdropyrazol-3-yl, 4,5-Dihdropyrazol-4-yl,  
4,5-Dihdropyrazol-5-yl, 2,3-Dihdrooxazol-2-yl, 2,3-Dihdrooxa-  
zol-3-yl, 2,3-Dihdrooxazol-4-yl, 2,3-Dihdrooxazol-5-yl, 3,4-Di-  
hydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl,  
3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxa-  
zol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl,  
4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyran-yl, 4-Tetrahy-  
dropyran-yl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexa-  
hydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl,  
5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-  
2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;

**Aryl:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem enthal-  
tend 6 bis 14 Kohlenstoffringglieder, z.B. Phenyl, Naphthyl und  
Anthracenyl;

30

**Aryloxy:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie  
vorstehend genannt), welches über ein Sauerstoffatom (-O-) an das  
Gerüst gebunden ist;

35 **Arylthio:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie  
vorstehend genannt), welches über ein Schwefelatom (-S-) an das  
Gerüst gebunden ist;

40 **Arylamino:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie  
vorstehend genannt), welches über eine Aminogruppe (-NH-) an das  
Gerüst gebunden ist;

45 **Arylcarbonyl:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem  
(wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylgruppe (-CO-)  
an das Gerüst gebunden ist;

10

**Aryloxycarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Aryloxygruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

5 **Arylthiocarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

**Arylaminocarbonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylaminogruppe (wie 10 vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (-CO-) an das Gerüst gebunden ist;

**Arylcarbonyloxy:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonyloxygruppe (-CO<sub>2</sub>-) an das Gerüst gebunden ist;

**Arylcarbonylthio:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylthiogruppe (-COS-) an das Gerüst gebunden ist;

20

**Arylcarbonylamino:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Carbonylamino-gruppe (-CONH-) an das Gerüst gebunden ist;

25 **Arylsulfonyl:** ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem (wie vorstehend genannt), welches über eine Sulfonylgruppe (-SO<sub>2</sub>-) an das Gerüst gebunden ist;

**Aryloxysulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Aryloxygruppe (wie 30 vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO<sub>2</sub>-) an das Gerüst gebunden ist;

**Arylthiosulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylthiogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO<sub>2</sub>-) an 35 das Gerüst gebunden ist;

**Arylaminosulfonyl:** eine ein- bis dreikernige Arylaminogruppe (wie vorstehend genannt), welche über eine Sulfonylgruppe (-SO<sub>2</sub>-) an das Gerüst gebunden ist;

40

**Heteroaryl:**

- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl,

## 11

3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl,  
5-Isoxazolyl, 3-Iothiazolyl, 4-Iothiazolyl, 5-Iothiazolyl,  
3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl,  
5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazo-  
5-lyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl,  
1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-  
3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und  
1,3,4-Triazol-2-yl;

- benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis
- 10 drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und ein Sauer-  
stoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche ne-  
ben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis  
drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als  
Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte
- 15 Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbar-  
tes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diyl-  
gruppe verbrückt sein können;
- über Stickstoff gebundenes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend  
ein bis vier Stickstoffatome, oder über Stickstoff gebundenes
- 20 benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis  
drei Stickstoffatome: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben  
Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome bzw. ein bis  
drei Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, und in  
welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stick-
- 25 stoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine  
Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können, wobei diese  
Ringe über eines der Stickstoffringglieder an das Gerüst gebun-  
den sind;
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis
- 30 vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben  
Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoff-  
atome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Py-  
ridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyri-  
midinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-  
35 Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

organischer Rest: ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cyclo-  
alkyl, Heterocyclyl, Aryl oder Hetaryl.

- 40 Der Zusatz "ggf. subst." in Bezug auf Alkyl-, Alkenyl- und  
Alkinylgruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen par-  
tiell oder vollständig halogeniert sein können [d.h. die Wasser-  
stoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch  
gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt  
45 (vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom) ersetzt sein] und/oder  
einen bis drei (vorzugsweise einen) der folgenden Reste tragen  
können:

## 12

- Cyano, Nitro, Hydroxy, Amino, Formyl, Carboxyl, Aminocarbonyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylcarbonylamino, Alkoxycarbonylamino, Alkylcarbonyl-N-alkylamino und Alkylcarbonyl-N-alkylamino, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;
  - unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkyl-N-alkylamino, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Heterocyclthio, Heterocycllamino oder Heterocyclyl-N-alkylamino, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 12 Ringglieder, vorzugsweise 2 bis 8 Ringglieder, insbesondere 3 bis 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;
  - unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl-N-alkylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylamino, Arylalkyl-N-alkylamino, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, Hetarylarnino, Hetaryl-N-alkylamino, Hetarylalkoxy, Hetarylalkylthio, Hetarylalkylamino und Hetarylalkyl-N-alkylamino, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, insbesondere 6 Ringglieder (Phenyl) enthalten, die Hetarylreste insbesondere 5 oder 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten.
- Der Zusatz "ggf. subst" in Bezug auf die cyclischen (gesättigten, ungesättigten oder aromatischen) Gruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können [d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugsweise Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere Fluor oder Chlor) ersetzt sein] und/oder einen bis vier (insbesondere einen bis drei) der folgenden Reste tragen können:
- Cyano, Nitro, Hydroxy, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Haloalkenyl, Alkenyloxy, Haloalkenyloxy, Alkinyl, Haloalkinyl, Alkinyloxy, Haloalkinylloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylcarbonylamino, Alkoxycarbonylamino, Alkylcarbonyl-N-alkylamino und Alkoxycarbonyl-N-alkylamino, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten.

lenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8, vorzugsweise 2 bis 6, insbesondere 2 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei (insbesondere einen) der folgenden Reste:

- 5 - unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Cycloalkylthio, Cycloalkylamino, Cycloalkyl-N-alkylamino, Heterocyclyl, Heterocyclyoxy, Heterocyclthio, Heterocyclamino oder Heterocyclyl-N-alkylamino, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 12 Ringglieder, vorzugsweise 2
- 
- 10 bis 8 Ringglieder, insbesondere 3 bis 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten;
- unsubstituiertes oder durch übliche Gruppen substituiertes
- 15 Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl-N-alkylamino, Arylalkoxy, Arylalkylthio, Arylalkylamino, Arylalkyl-N-alkylamino, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, Hetarylarnino, Hetaryl-N-alkylamino, Hetarylalkoxy, Hetarylalkylthio, Hetarylalkylamino und Hetarylalkyl-N-alkylamino, wobei die Arylreste vorzugsweise 6
- 20 bis 10 Ringglieder, insbesondere 6 Ringglieder (Phenyl) enthalten, die Hetarylreste insbesondere 5 oder 6 Ringglieder enthalten und die Alkylgruppen in diesen Resten vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome enthalten
- 25 und/oder einen oder zwei (insbesondere einen) der folgenden Reste trage kann:
- Formyl,
- C<sub>R111</sub>=NOR<sub>IV</sub> [wobei R<sub>111</sub> Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl und Aryl und R<sub>IV</sub> Alkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkinyl und Arylalkyl
- 30 bedeutet (wobei die genannten Alkylgruppen vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatome, enthalten, die genannten Cycloalkylgruppen, Alkenylgruppen und Alkinylgruppen vorzugsweise 3 bis 8, insbesondere 3 bis 6, Kohlenstoffatome enthalten) und Aryl insbesondere Phenyl bedeutet, welches unsubstituiert ist oder durch übliche Gruppen substituiert sein kann] oder
- NRV-CO-D-R<sub>VI</sub> [wobei RV für Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-
- 40 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl steht, R<sub>VI</sub> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl und Hetaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht und D eine direkte Bindung, Sauerstoff oder Stickstoff bedeutet, wobei der Stickstoff eine der bei R<sub>VI</sub> genannten Gruppen tragen kann],

## 14

und/oder bei denen zwei benachbarte C-Atome der cyclischen Systeme eine C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylen-, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkenylen-, Oxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkylen-, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, Oxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkenylen-, Oxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkenylenoxy- oder Butadiendiylgruppe tragen können, wobei diese Brücken ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen bis drei, insbesondere einen oder zwei der folgenden Reste tragen können:

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio.

10

Unter üblichen Gruppen sind insbesondere die folgenden Substituenten zu verstehen: Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio.

15

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der 5-Hydroxypyrazoline der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

20

Insbesondere werden Verbindungen IA bevorzugt.

Außerdem werden Verbindungen IB.1 besonders bevorzugt.

25 Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen IB.2.

Desweiteren werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht.

30 Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>F<sub>7</sub> oder C<sub>2</sub>F<sub>5</sub> steht.

35

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für gegebenenfalls para-substituiertes Phenyl steht.

40 Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen B für Phenyl steht, welches einen Substituenten in 2-Stellung trägt.

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen B für Heteroaryl steht.

45

Desweiteren werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> für Wasserstoff stehen.

15

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R<sup>4</sup> für Methyl steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>4</sup> für Trifluormethyl steht.

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen die Substituenten R<sup>1</sup> und R<sup>4</sup> verschieden sind.

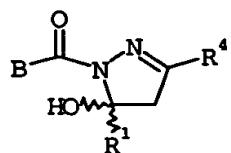
10 Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>4</sup> für cyano, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die 15 in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

20 Tabelle 1

Verbindungen der allgemeinen Formel IA', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, R<sup>4</sup> für Methyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25



IA'

Tabelle 2

30 Verbindungen der allgemeinen Formel IA', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, R<sup>4</sup> für Ethyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

35 Verbindungen der allgemeinen Formel IA', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>F<sub>7</sub>, R<sup>4</sup> für Methyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

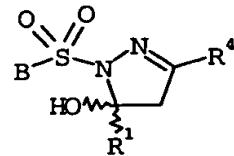
Tabelle 4

40 Verbindungen der allgemeinen Formel IA', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>F<sub>7</sub>, R<sup>4</sup> für Ethyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

45 Verbindungen der allgemeinen Formel IB.1', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, R<sup>4</sup> für Methyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

16



IB.1'

5

## Tabelle 6

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.1', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, R<sup>4</sup> für Ethyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 7

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.1', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>F<sub>7</sub>, R<sup>4</sup> für Methyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 8

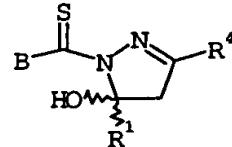
Verbindungen der allgemeinen Formel IB.1', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>F<sub>7</sub>, R<sup>4</sup> für Ethyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 9

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.2', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, R<sup>4</sup> für Methyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25



IB.2'

30 Tabelle 10

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.2', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, R<sup>4</sup> für Ethyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35 Tabelle 11

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.2', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>F<sub>7</sub>, R<sup>4</sup> für Methyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 12

Verbindungen der allgemeinen Formel IB.2', in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>F<sub>7</sub>, R<sup>4</sup> für Ethyl und B für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45

Tabelle A

Nr.	B
5	A-1 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	A-2 2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-3 3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-4 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-5 2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10	A-6 3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-7 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-8 2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-9 3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-10 4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	A-11 2-OH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-12 3-OH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-13 4-OH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-14 2-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-15 3-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
20	A-16 4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-17 2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-18 3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-19 4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-20 2-NH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
25	A-21 3-NH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-22 4-NH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-23 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-24 3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-25 4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
30	A-26 2-N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-27 3-N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-28 4-N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-29 2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-30 3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
35	A-31 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-32 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-33 3-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-34 4-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-35 2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
40	A-36 3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-37 4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	A-38 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

Nr.	B
A-39	3-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
A-40	4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
5 A-41	2-(O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
A-42	3-(O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
A-43	4-(O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
A-44	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
10 A-45	3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-46	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-47	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-48	2,4-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
15 A-49	3,5-Br <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-50	2-F-4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-51	3-F-5-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-52	2-F-4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
20 A-53	3-F-5-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-54	2-Cl-4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-55	3-Cl-5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-56	2-Cl-4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
25 A-57	3-Cl-5-Br-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-58	2-Br-4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-59	3-Br-5-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-60	2-Br-4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
A-61	3-Br-5-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

30 Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

35 Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

40 45 Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- Alternaria-Arten an Gemüse und Obst,
  - Botrytis cinerea (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
  - Cercospora arachidicola an Erdnüssen,
- 5 • Erysiphe cichoracearum und Sphaerotheca fuliginea an Kürbisgewächsen,
- Erysiphe graminis (echter Mehltau) an Getreide,
  - Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen,
  - Helminthosporium-Arten an Getreide,
- 
- 10 • Mycosphaerella-Arten an Bananen und Erdnüssen,
  - Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
  - Plasmopara viticola an Reben,
  - Podosphaera leucotricha an Äpfeln,
  - Pseudocercosporella herpotrichoides an Weizen und Gerste,
- 15 • Pseudoperonospora-Arten an Hopfen und Gurken,
- Puccinia-Arten an Getreide,
  - Pyricularia oryzae an Reis,
  - Rhizoctonia-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
  - Septoria nodorum an Weizen,
- 20 • Uncinula necator an Reben,
- Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
  - Venturia-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder  
25 die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

30

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je  
35 nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm  
40 Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im  
45 Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffes mit Lösungsmitteln und/oder

- 10 Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- 25 Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfinsäure, Naphthalinsulfinsäure, Phenolsulfinsäure, Dibutynaphthalinsulfinsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem
- 30 Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfonierte Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfinsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenol-
- 35 polyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.
- 40 Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs,
- 45 aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol,

Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

5

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

- 
- 10 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde,
- 15 Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

20

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

25

Beispiele für Formulierungen sind:

- I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 30 II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kiesel-säuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kiesel-säuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- 35 III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
- 40
- 45

## 22

IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-

10 pha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).

15 VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- $\alpha$ -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).

20 VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

30 VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionsen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder 5 in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung 10 mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 15 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff 20 ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden. 25

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der 30 z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

- 35 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:
- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zink-ethylendiamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), 40 Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)disulfid;
  - 45

## 24

- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
  - 5 • heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin,
- 
- 10 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetra-chlorethylthio)-tetrahydronaphthalimid, N-Trichlormethylthio-te-trahydronaphthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
- 15 • N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethyliobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazone)-3-methyl-5-isoxazolon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Tri-methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbon-säurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoësäure-anilid, 2-Iod-benzoësäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacet-al, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan,
- 20 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin,
- 25 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphen-oxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon,
- 30 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorophenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol,  $\alpha$ -(2-Chlorphenyl)- $\alpha$ -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-me-thoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- 35 45 • Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(o-tolyloxy)-o-to-lyl]acetat, Methyl-E-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yl-

oxy]-phenyl}-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[ $\alpha$ -(2,5-dimethylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid,

- Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin,

5 N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,

- Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,

10 • Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphe-nyl)-acrylsäuremorpholid,

- sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-ala-

15 nin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-ami-nobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxy-methyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-iso-

20 propylcarbamoylydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcy-clopropan-1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-[N-(ethyl-aminocarbo-nyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Di-chlorphenyl)-pen-tyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- $\alpha$ -(1H-1,2,4-triazolyl-1-me-thyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluorme-

25 thyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

### Synthesebeispiele

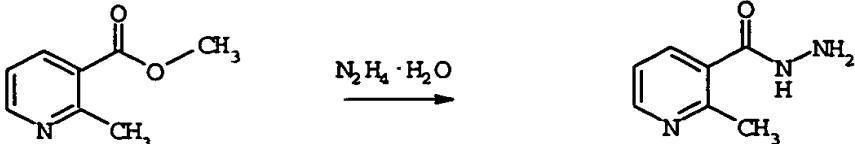
30 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vor-schriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangs-verbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

35

#### A) Herstellung der Vorprodukte

##### Beispiel 1 Herstellung von 2-Methyl-Pyridin-3-carbonsäurehydrazid

40



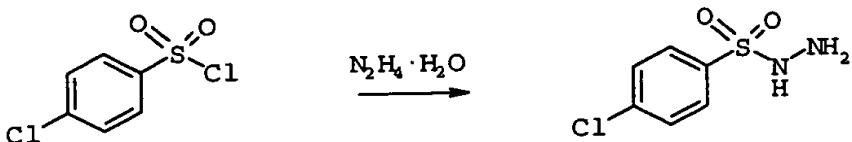
Eine Lösung von 1 g 2-Methyl-Pyridin-3-carbonsäuremethylester in  
45 5 ml Methanol wurde nach Versetzen mit 3 g Hydrazinhydrat 14 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Nach Verdünnen mit Wasser wurde mit Methylenchlorid extrahiert. Aus den vereinigten organischen Phasen

26

wurde nach Abdestillieren des Lösungsmittels 0,45 g der Titelverbindung als farblose Kristalle vom Fp. 60°C.

Beispiel 2 Herstellung von 4-Chlorphenylsulfonylhydrazid

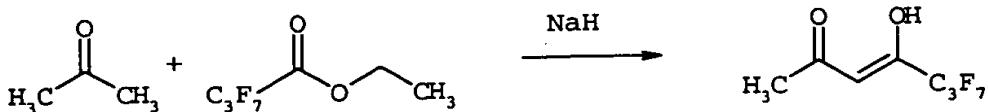
5



10 Zu einer Lösung von 50 g (0,24 mol) 4-Chlorphenylsulfonylchlorid in 300 ml THF wurden bei 10 bis 20°C unter Rühren 24 g (0,48 mol) Hydrazinhydrat, in 25 ml Wasser gelöst, zugetropft. Nach 15 min Rühren bei etwa 15°C wurde die Reaktionsmischung auf Eis gegeben. Nach Einengen der Lösung wurde der Niederschlag abfiltriert. Es 15 wurden 40 g der Titelverbindung als farblose Kristalle vom Fp. 79°C isoliert.

Beispiel 3 Herstellung von  
5,5,6,6,7,7,7-Heptafluoro-2,4-heptandion

20



25 4,1 g (170 mmol) Natriumhydrid (97%) in 45 ml wasserfr. Cyclohexan wurden mit einer Mischung von 68,4 g (300 mmol) Perfluorbuttersäuremethylester und 8,7 g (150 mmol) wasserfr. Aceton bei 30°C versetzt. Nach 14 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde mit dest. Wasser verdünnt, dann mit verd. Salzsäure angesäuert. Nach Phasentrennung wurde die wässrige Phase mit Diethlether extrahiert. Die 30 vereinigten organischen Phasen wurden nach Waschen mit Wasser über eine 40 cm Vigreux-Kolonne fraktioniert. Es wurden 22 g der Titelverbindung als farblose Flüssigkeit vom Sdp. 135°C erhalten.

<sup>1</sup>H-NMR ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  (ppm) = 2,1 (s, 3H); 5,95 (s, 1H).

35

Beispiel 4 Herstellung von 5,5,6,6,6-Pentafluoro-2,4-hexandion

Unter den in Beispiel 3 genannten Bedingungen wurden durch Umsetzung von 2,7 g Natriumhydrid in 27 ml Cyclohexan mit 5,8 g (100 mmol) Aceton und 38,4 g (200 mmol) Perfluorpropionsäureethylester 40 19,4 g der Titelverbindung als farblose Flüssigkeit erhalten mit Sdp. von 119°C erhalten.

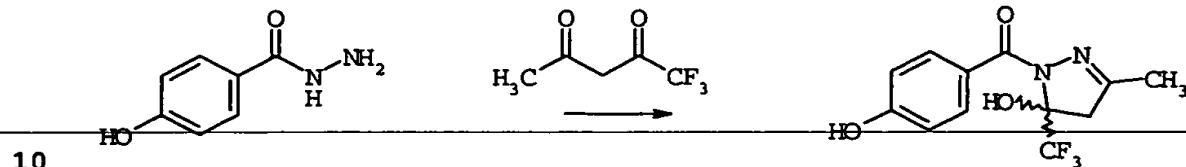
<sup>1</sup>H-NMR ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  (ppm) = 2,1 (s, 3H); 5,95 (s, 1H).

45

## B) Herstellung der Wirkstoffe

## Beispiel 4 Herstellung von

5 5-Hydroxy-5-trifluormethyl-3-methyl-4,5-dihydro-pyrazol-1-yl-(4-hydroxyphenyl)-methanon [I-73]



Eine Lösung von 5 g (33 mmol) 4-Hydroxybenzoesäurehydrazid und 5 g (33 mmol) Trifluoracetylaceton in 100 ml Ethanol wurde 6 Std. auf 70°C erhitzt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurden 15 9,0 g der Titelverbindung als farblose Kristalle erhalten.

## Beispiel 5 Herstellung von

5-Hydroxy-5-(1,1,1,2,2-pentafluorethyl)-3-methyl-4,5-dihydro-pyrazol-1-yl-(4-bromphenyl)-methanon [I-13]

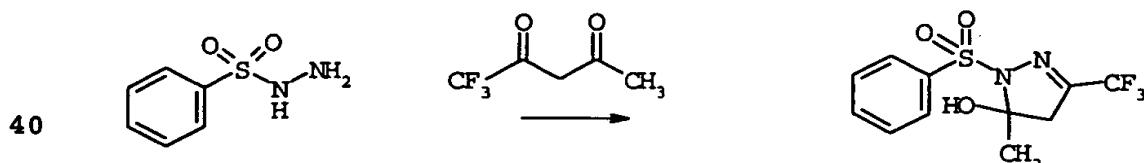
20 Unter den in Beispiel 4 genannten Bedingungen wurden durch Umsetzung von 1 g (5 mmol) 4-Brombenzoic acid hydrazide mit 1 g (5 mmol) 5,5,6,6,6-Pentafluoro-2,4-hexandion in 100 ml Ethanol 1,9 g der Titelverbindung als farblose Kristalle erhalten.

## Beispiel 6 Herstellung von

5-Hydroxy-5-(1,1,1,2,2,3,3-heptafluorpropyl)-3-methyl-4,5-dihydro-pyrazol-1-yl-phenyl-methanon [I-35]

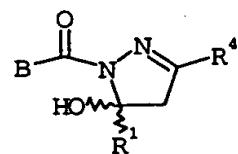
30 Unter den in Beispiel 4 genannten Bedingungen wurden durch Umsetzung von 0,8 g (6 mmol) Benzoesäurehydrazid mit 1,5 g (6 mmol) 5,5,6,6,7,7,7-Heptafluoro-2,4-heptandion in 100 ml Ethanol 9,0 g der Titelverbindung als farblose Kristalle erhalten.

## 35 Beispiel 7 Herstellung von 2-Benzolsulfonyl-3-trifluormethyl-5-methyl-3,4-dihydro-2H-pyrazol-3-ol [II-1]



Eine Lösung von 1 g (6 mmol) Benzolsulfonsäurehydrazid und 0,9 g (6 mmol) Trifluoracetylaceton in Ethanol wurde 6 Std. auf 70°C erhitzt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurden 1,6 g der Titelverbindung als farblose Kristalle erhalten.

Tabelle I



IA'

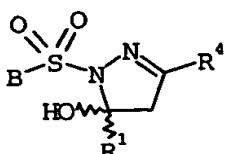
Nr.	B	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	phys. Daten (Fp. [°C])
10	I-1 Phenyl	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	COOCH <sub>3</sub>	136-139
	I-2 Phenyl	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	133-137
	I-3 Phenyl	4-Br-Phenyl	CH <sub>3</sub>	176-180
	I-4 Phenyl	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	172-178
	I-5 2-OH-Phenyl	4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	Ö1
15	I-6 Phenyl	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	COOCH <sub>3</sub>	179-183
	I-7 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	>200
	I-8 2-OH-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	96
	I-9 2-OH-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	173
	I-10 3-Cl-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	120
20	I-11 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	144
	I-12 3-OH-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	83
	I-13 4-Br-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	135
	I-14 4-Cl-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	110
	I-15 4-CN-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	98
25	I-16 4-F-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	123
	I-17 4-OH-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	141
	I-18 2-OH-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	tert.-Butyl	Ö1
	I-19 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	tert.-Butyl	72
	I-20 4-Br-Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	tert.-Butyl	150
30	I-21 2-OH-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	2-Thienyl	Ö1
	I-22 2-OH-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CF <sub>3</sub>	120
	I-23 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CF <sub>3</sub>	73
	I-24 4-Br-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CF <sub>3</sub>	128
	I-25 2-OH-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	145
35	I-26 3-Br-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	88
	I-27 3-Cl-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	99
	I-28 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	95
	I-29 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	100
	I-30 4-Br-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	117
40	I-31 4-Cl-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	120
	I-32 4-CN-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	115
	I-33 4-F-Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	145

Nr.	B	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	phys. Daten (Fp. [°C])
5	I-34 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	121
	I-35 Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	129
	I-36 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	2-Thienyl	75
	I-37 2-OH-Phenyl	CF <sub>3</sub>	2-Thienyl	Ö1
	I-38 4-Br-Phenyl	CF <sub>3</sub>	2-Thienyl	128
	I-39 2-OH, 5-Cl-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	70
10	I-40 3-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	128
	I-41 4-Br-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	139
	I-42 4-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	160
	I-43 6-CH <sub>3</sub> -Pyridyl-2	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	95
	I-44 2-OH-Phenyl	CF <sub>3</sub>	iPr	Ö1
15	I-45 4-Br-Phenyl	CF <sub>3</sub>	iPr	94
	I-46 1-Naphtyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	156
	I-47 2,4-Cl <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	153
	I-48 2,5-Cl <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	124
	I-49 2-Cl-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	100
20	I-50 2-F, 6-NH <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	97
	I-51 2-CH <sub>3</sub> -Pyridyl-3	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	116
	I-52 2-OH, 5-Cl-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	140
	I-53 2-OH-Naphtyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	209
	I-54 2-OH-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	150
25	I-55 3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	100
	I-56 3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	121
	I-57 3,4-Cl <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	107
	I-58 3,5-(OH) <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	75
	I-59 3-Br-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	61-67
30	I-60 3-Cl-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Ö1
	I-61 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	58
	I-62 3-NH <sub>2</sub> , 4-OH-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	123
	I-63 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	82
	I-64 3-OH-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Ö1
35	I-65 3-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	68
	I-66 4-Br-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	116
	I-67 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	56
	I-68 4-Cl-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	95
	I-69 4-CN-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	134
40	I-70 4-F-Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	63
	I-71 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	89

Nr.	B	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	phys. Daten (Fp. [°C])
I-72	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	110
5	I-73	4-OH-Phenyl	CF <sub>3</sub>	120
	I-74	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	Öl
	I-75	4-Phenyl-Phenyl	CF <sub>3</sub>	146
	I-76	4-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	103
	I-77	4-tert.-Butyl- Phenyl	CF <sub>3</sub>	96
10	I-78	6-Cl-Pyridyl -2	CF <sub>3</sub>	Öl
	I-79	6-CH <sub>3</sub> -Pyridyl-2	CH <sub>3</sub>	90
	I-80	Phenyl	CF <sub>3</sub>	65
	I-81	2-OH-Phenyl	CF <sub>3</sub>	tert.-Butyl 123
	I-82	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	tert.-Butyl 86
15	I-83	2-NH <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	122-128
	I-84	2-OH, 4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	130
	I-85	2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	Öl
	I-86	3, 4, 5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> - Phenyl	CH <sub>3</sub>	Öl
	I-87	3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	97
20	I-88	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	Öl
	I-89	3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	Öl
	I-90	4-Br-Phenyl	CH <sub>3</sub>	102
	I-91	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	76
	I-92	4-CN-Phenyl	CH <sub>3</sub>	124
25	I-93	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	145
	I-94	4-Cl-Phenyl	Phenyl	147-154
	I-95	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Phenyl	163-171
	I-96	4-Br-Phenyl	Phenyl	162
	I-97	Phenyl	Phenyl	87-93
30	I-98	Phenyl	tert.-Butyl	iso-Propyl 66-74
	I-99	Phenyl	tert.-Butyl	n-Butyl 73-80
	I-100	Phenyl	tert.-Butyl	tert.-Butyl 62-68

Tabelle II

5



IB.1'

10

Nr.	B	R¹	R⁴	phys. Daten (Fp. [°C])
II-1	Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	88
II-2	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	104
II-3	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	106

## Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

15

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

20 Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol® EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen *Phytophthora infestans* an Tomaten

30 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate" wurden mit einer wässrigen Suspension, die aus einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Zoosporenaufschwemmung von *Phytophthora infestans* infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 16 und 18°C aufgestellt. Nach 6 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, daß der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

40 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-1 bis I-4, I-6, I-7, I-9 bis I-11, I-13 bis I-16, I-26 bis I-35, I-53, I-59, I-60, I-63, I-68, I-72, I-74, I-94, I-95 und I-97 behandelten Pflanzen bis zu 10 % Befall, während unbehandelten Pflanzen 45 zu 100 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola*

Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnäße besprüht. Um die Dauerwirkung der Substanzen beurteilen zu können, wurden die Pflanzen nach dem An- trocknen des Spritzbelages für 7 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoosporenauf-

schwemmung von *Plasmopara viticola* inkuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24°C und anschließend für 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-3, I-4, I-10, I-11, I-27, I-34, I-35, I-46, I-47, I-53, I-54 und I-73 behandelten Pflanzen nicht über 30 % Befall, während unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 3 - Wirksamkeit gegen *Botrytis cinerea* an Paprikablättern

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wäßrigen Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1,7 \times 10^6$  Sporen/ml in einer 2 %igen wäßrigen Biomalzlösung enthielt, inkuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefall auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-11, I-13, I-24, I-26, I-29, I-30, I-45, I-47, I-57 bis I-61, I-63, I-64, I-68, I-70, I-71, I-74, I-80 und I-94 behandelten Pflanzen maximal 20 % Befall, während unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

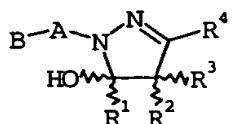
Verwendung von substituierten 5-Hydroxypyrazolen, neue 5-Hydroxypyrazole, Verfahren zu deren Herstellung, sowie sie enthaltende Mittel

5

### Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von 5-Hydroxypyrazolinen der Formel I

10



I

15 in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

B Aryl oder Hetaryl;

A C=O, C=S oder SO<sub>2</sub>;

20

R<sup>1</sup> Alkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkinyl oder Halogenalkinyl,

Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkenyl, Cycloalkinyl, oder

25

Aryl, Heterocyclyl oder Hetaryl;

R<sup>2</sup> Wasserstoff;

30 R<sup>3</sup>

Wasserstoff, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkinyl oder Halogenalkinyl, wobei

R' unabhängig voneinander Wasserstoff oder Alkyl bedeutet;

35

oder R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> gemeinsam eine Gruppe

=O, =S oder =N-O-R<sup>5</sup>, wobei

40

R<sup>5</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkinyl oder Halogenalkinyl bedeutet;

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, N(R')<sub>2</sub>, Alkyl, Halogenalkyl, COOR' oder Heterocyclyl;

45

zur Bekämpfung von Schadpilzen, sie enthaltende Mittel, sowie neue 5-Hydroxypyrazole und Verfahren zu deren Herstellung.